

= US 4,567,63

(7)



Europäisches Patentamt
European Patent Office
Office européen des brevets

⑪ Veröffentlichungsnummer:

0071 792
A2

⑫

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

⑬ Anmeldenummer: 82106335.1

⑮ Int. Cl.³: C 07 D 487/04, A 01 N 43/90

⑭ Anmeldetag: 15.07.82

//

(C07D487/04, 239/00, 231/00),
(C07D487/04, 249/00,
239/00)

⑯ Priorität: 01.08.81 DE 3130633

⑰ Anmelder: BASF Aktiengesellschaft,
Carl-Bosch-Strasse 38, D-6700 Ludwigshafen (DE)

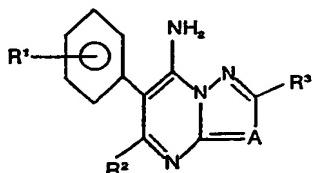
⑲ Veröffentlichungstag der Anmeldung: 16.02.83
Patentblatt 83/7

⑳ Erfinder: Eicken, Karl, Dr., Waldstrasse 63,
D-6706 Wachenheim (DE)
Erfinder: Scheib, Klaus, Dr., Duerkheimer Strasse 7,
D-6701 Schauernheim (DE)
Erfinder: Theobald, Hans, Dr., Parkstrasse 2,
D-6703 Limburgerhof (DE)
Erfinder: Pommer, Ernst-Heinrich, Dr., Berliner Platz 7,
D-6703 Limburgerhof (DE)
Erfinder: Ammermann, Eberhard, Dr., Sachsenstrasse 3,
D-6700 Ludwigshafen (DE)

㉑ Benannte Vertragsstaaten: AT BE CH DE FR GB IT LI LU
NL SE

㉒ 7-Amino-azolo(1,5-a)pyrimidine und diese enthaltende Fungizide.

㉓ 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine der Formel



worin

R¹ gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxy, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls substituiert sind.

R² und R³ Wasserstoff, Alkyl oder Aryl,
n 1 oder 2,

A ein Stickstoffatom oder eine CR⁴-Gruppe bedeutet,
wobei

R⁴ die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxycarbonyl und zusammen mit R³ eine Alkenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet und diese enthaltende Fungizide.

EP 0071 792 A2

0071792

O.Z. 0050/35319

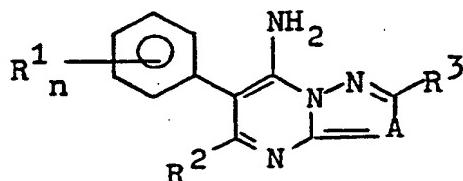
BASF Aktiengesellschaft

7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine und diese enthaltende
Fungizide

Die vorliegende Erfindung betrifft neue 7-Amino-azolo-[1,5-a]pyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und diese
enthaltende Fungizide.

Es ist bekannt, daß 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine z.B.
das 7-Amino-2-methyl-5-phenyl-pyrazolo[1,5-a]pyrimidin
pharmakologische Eigenschaften besitzen (FR-PS 2 448 542;
DD-PS 99 794; DD-PS 55 956; J. pharm. Soc. Japan 84
(1964), S. 1113-1118). Es ist ferner bekannt, N-Trichlor-
methylthio-phthalimid als Fungizid zu verwenden (Chemical
Week 1972, June 21, Seite 63).

Es wurde nun gefunden, daß neue 7-Amino-azolo[1,5-a]pyri-
midine der Formel



worin

R¹ gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substitu-
iertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl,
Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi,
Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol,
Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls
im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen
oder Cyano substituiert sind,

n 1 oder 2,

R² und R³ Wasserstoff, Alkyl oder Aryl,

35 Sws/P

- 7 A ein Stickstoffatom oder eine CR⁴-Gruppe bedeuten,
 wobei
 R⁴ die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen,
 Cyano, oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R³ eine
 5 Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu zwei Doppel-
 bindungen bedeutet,
 eine gute fungizide Wirkung, insbesondere gegen Phycomyceten
 haben.
- 10 Unter den Resten R¹ sind beispielsweise gegebenenfalls
 durch Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkoxi substituiertes
 C₁-C₁₂-Alkyl, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₁₂-Alkoxi, Cyano,
 C₃-C₈-Cycloalkyl, Aryl (Phenyl), Aryloxi (Phenyloxi), Aryl-
 thio (Phenylthio), Arylalkyl (Benzyl), Arylalkyloxi
 15 (Benzylloxi), Arylalkylthio (Benzylthio) mit 1 bis 6 Kohlen-
 stoffatomen in den Alkylteilen, mit dem Phenylring annellier-
 tes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche ge-
 gebenenfalls im aromatischen Teil durch C₁-C₄-Alkyl,
 C₁-C₄-Alkoxi, Cyano, Fluor, Chlor oder Brom substituiert
 20 sein können, zu verstehen.
- Unter den Resten R², R³ und R⁴ in der Bedeutung von R² ist
 beispielweise Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder gegebenenfalls
 durch Chlor, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxi substituiertes
 25 Phenyl zu verstehen. Darüber hinaus kann R⁴ Chlor, Brom,
 Cyan oder C₁-C₄-Alkoxicarbonyl bedeuten oder zusammen mit
 R³ eine gegebenenfalls bis zu zwei Doppelbindungen enthal-
 tende C₃-C₄-Alkylenkette bedeuten. Unter Alkyl oder Alkyl
 einer Alkoxigruppe bei den Resten R¹, R², R³ und R⁴ ist
 30 je nach Zahl der angegebenen Kohlenstoffatome Methyl, Ethyl,
 Propyl, Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl, Octyl, Nonyl, Decyl,
 Undecyl oder Dodecyl und ihre Isomeren zu verstehen.
- Es wurde ferner gefunden, daß man 7-Amino-azolo[1,5-a]-
 35 -pyrimidine der Formel I erhält, indem man substituierte

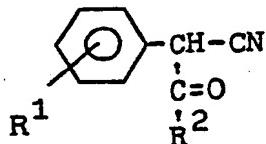
0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 3 -

O.Z. 0050/35319

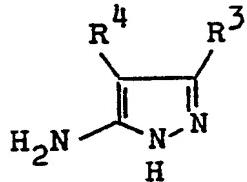
5 " Benzylcyanide der Formel



II,

5

in welcher R¹ und R² die oben angegebenen Bedeutungen
haben, mit 5(3)-Aminopyrazolen der Formel

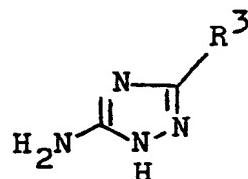


III,

10

oder mit

15 5(3)-Amino-1,2,4-triazolen der Formel



IV,

20

in welcher R³ und R⁴ die oben angegebenen Bedeutungen
haben, umsetzt.

25

Die Umsetzung kann in Gegenwart oder Abwesenheit von
Lösungsmitteln durchgeführt werden. Vorteilhaft ist es,
solche Lösungsmittel zu verwenden, gegenüber denen die
Einsatzstoffe weitgehend inert sind und in denen sie ganz
oder teilweise löslich sind. Als Lösungsmittel kommen ins-
besondere Alkohole wie Ethanol, Propanole, Butanole, Glyko-
le oder Glykolmonoether, Diethylenglykole oder deren
Monoether, Amide wie Dimethylformamid, Diethylformamid,
Dibutylformamid, N,N-Dimethylacetamid, niedere Alkansäuren
wie Ameisensäure, Essigsäure, Propionsäure und Mischungen
dieser Lösungsmittel mit Wasser in Frage. Die Umsetzungs-
30

35

0071792

BASF Aktiengesellschaft

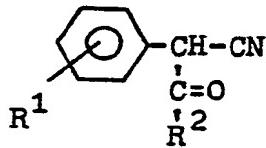
- 4 -

O.Z. 0050/35319

* Temperaturen liegen zwischen 50 und 300°C, vorzugsweise bei 50 bis 150°C, wenn in Lösung gearbeitet wird.

Die neuen 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine werden gegebenenfalls nach Verdampfen des Lösungsmittels oder Verdünnen mit Wasser als kristalline, meist sehr reine Verbindungen isoliert. Bei Verwendung von niederen Alkansäuren als Lösungsmitteln ist es zweckmäßig, gegebenenfalls nach teilweisem Verdampfen der Alkansäure, die Reste der Alkan-
säure durch Zugabe von wäßrigem Alkali zu neutralisieren, wobei die neuen 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine meist in sehr reiner Form auskristallisieren.

Die für die Herstellung der 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine benötigten substituierten Benzylcyanide der Formel



II,

sind teilweise bekannt oder können nach bekannten Methoden aus Benzylcyaniden und Carbonsäureestern mit Alkalialkoholaten oder Alkalihydriden hergestellt werden (J. Amer. Chem. Soc. 73, (1951) S. 3766).

Allgemeine Herstellungsvorschrift für die substituierten Benzylcyanide der Formel II

1,5 Mol Natriumalkoholat wird in 1 l Toluol eingetragen und anschließend 1,0 Mol eines Benzylcyanids und dann 2,0 Mol eines Carbonsäureesters unter Rühren zugetropft, wobei die Temperatur auf 40 bis 50°C ansteigt. Nach 2-stündigem Nachrühren bei 75 bis 80°C wird abgekühlt und mit 2 l Wasser versetzt. Aus der wäßrigen Phase isoliert man nach zweimaligem Waschen mit 0,2 l Toluol durch Ansäuern

0071792

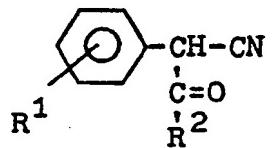
BASF Aktiengesellschaft

- 5 -

O.Z. 0050/35319

mit halbkonzentrierter (etwa 50 Gew.%) Schwefelsäure auf pH 2 das substituierte Benzylcyanid der Formel II (Ausbeuten: 70 bis 90 %).

- 5 Auf diese Weise können folgende substituierten Benzylcyanide der Formel



hergestellt werden:

20

25

30

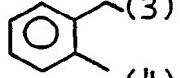
35

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 6 -

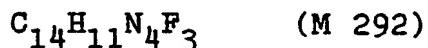
O.Z. 0050/35319

	R ¹	R ²	Fp. (°C)
5	2-CH ₃	H	89
	3-CH ₃	H	119
	4-C(CH ₃) ₃	H	169
	3-CH ₃ O	H	102
	3-Cl	H	178
	4-Cl	H	164
10	4-Br	H	176
	3-CF ₃	H	107
	3-CF ₃	CH ₃	82
	3-C ₆ H ₅ O	H	45
	4-C ₂ H ₅	H	90
	4-C ₆ H ₁₃ O	H	116
15	4- ¹⁰ C ₃ H ₇	H	84
	 (3)	H	205
20	 (4)	H	205
	3,4-Cl ₂	H	170
	2-CH ₃ , 4-C(CH ₃) ₃	H	120
	4-C ₆ H ₅	H	228
	4-C ₆ H ₅ CH ₂ -O	H	188
	4-(ClCH ₂ CH(CH ₃)CH ₂)	H	81
25	2,4-Cl	H	166
	4-CN	H	222
	 R ¹ = <i>β</i> -Naphthyl	H	
	 R ¹ = <i>α</i> -Naphthyl	H	
	30		

Die folgenden Beispiele betreffen die Herstellung der neuen Wirkstoffe.

Beispiel 1

5 21,3 g m-Trifluormethyl-2-formyl-benzylcyanid und 9,7 g
3(5)-Amino-5(3)-methylpyrazol wurden in 100 ml Eisessig
4 Stunden am Rückfluß erhitzt. Nach dem Abkühlen wurde der
Ansatz mit 500 ml Wasser verdünnt und mit 2 n NaOH-Lösung
10 auf pH 5 bis 6 eingestellt, wobei ein öliges Produkt aus-
fiel, das nach Anreiben kristallisierte. Nach Absaugen
der Kristalle, mehrfachen Waschen mit Wasser und Trocknen
im Vakuum bei 50°C erhielt man 25,0 g 7-Amino-2-methyl-6-
-(3'-trifluormethylphenyl)pyrazolo[1,5-a]pyrimidin vom
15 Fp. 176°C (Verbindung 10).



	C	H	N
20	ber.: 57,54	3,79	19,17
	gef.: 57,6	3,9	18,9

Beispiel 2

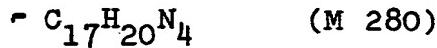
25 10,5 g p-tert.-Butyl-2-formyl-benzylcyanid und 4,8 g
3(5)-Amino-5(3)-methylpyrazol wurden in 40 ml Dimethyl-
formamid 3 Stunden am Rückfluß erhitzt. Nach dem Abkühlen
wurden 150 ml Wasser zugetropft. Nach dem Absaugen der
Kristalle, Waschen mit Wasser und Trocknen im Vakuum bei
30 50°C erhielt man 11,3 g 7-Amino-2-methyl-6-(4'-tert.butyl-
phenyl)pyrazolo[1,5-a]pyrimidin vom Fp. 218°C (Verbin-
dung 5).

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 8 -

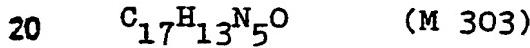
O.Z. 0050/35319



	C	H	N
ber.:	72,83	7,19	19,98
5 gef.:	72,8	7,1	19,9

Beispiel 3

11,8 g m-Phenoxy-2-formylbenzylcyanid und 4,3 g 3-Amino-
 10 triazol wurden in 40 ml Eisessig 6 Stunden am Rückfluß
 erhitzt, nach dem Abkühlen mit 300 ml Wasser versetzt und
 mit 2 n NaOH auf pH 6 eingestellt. Die ausgefallenen
 Kristalle wurden abgesaugt und getrocknet (14,1 g). Nach
 Lösen in 30 ml heißem Dimethylformamid abkühlen, Fällen
 15 mit 10 ml Methanol, Waschen der abgesaugten Kristalle
 mit weiterem Methanol und Trocknen erhielt man 9,6 g
 7-Amino-6-(3'-phenoxyphenyl)-1,2,4-triazolo[1,5-a]pyrimidin
 vom Fp. 248-250°C (Verbindung 44).

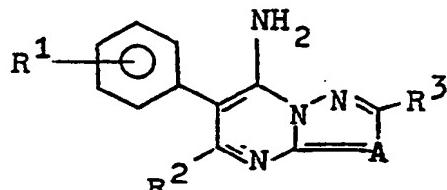


	C	H	N
ber.:	67,32	4,32	23,09
gef.:	67,8	4,2	22,9

25 Nach den oben beschriebenen Verfahren wurden folgende
 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine hergestellt.

30

35



Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	Fp. (°C)
1	3-CF ₃	CH ₃	CH ₃	H	CR ⁴	212
10	2	3,4(CH ₃ O) ₂	CH ₃	H	CR ⁴	188
	3	2-CH ₃	H	CH ₃	CR ⁴	224
	4	3-CH ₃	H	CH ₃	CR ⁴	158
	5	4-C(CH ₃) ₃	H	CH ₃	CR ⁴	218
	6	3-CH ₃ O	H	CH ₃	CR ⁴	124
	7	3-Cl	H	CH ₃	CR ⁴	174
15	8	4-Cl	H	CH ₃	CR ⁴	168
	9	4-Br	H	CH ₃	CR ⁴	171
	10	3-CF ₃	H	CH ₃	CR ⁴	176
	11	3-C ₆ H ₅ O	H	CH ₃	CR ⁴	173
	12	4-C ₂ H ₅	H	CH ₃	CR ⁴	150
	13	4-H ₁₃ C ₆ O	H	CH ₃	CR ⁴	132
20	14	Phenyl (3) (4)	H	CH ₃	CR ⁴	328
	15	4-iC ₃ H ₇	H	CH ₃	CR ⁴	162
	16	3,4-Cl ₂	H	CH ₃	CR ⁴	160
	17	4-C(CH ₃) ₃ ; 2-CH ₃	H	CH ₃	CR ⁴	238
	18	4-C ₆ H ₅	H	CH ₃	CR ⁴	197
	19	4-C ₆ H ₅ -CH ₂ O	H	CH ₃	CR ⁴	160
25	20	4-(ClCH ₂ CH(CH ₃)CH ₂)	H	CH ₃	CR ⁴	168
	21	2,4-Cl ₂	H	CH ₃	CR ⁴	245
	22	3-CF ₃	H	<u>H</u> —C ₆ H ₅	CR ⁴	184
	23	3-CF ₃	H	CH=CH-CH=CH	CR ⁴	243
	24	4-C(CH ₃) ₃	H	CH=CH-CH=CH	CR ⁴	248
	25	4-CH ₃ O	CH ₃	CH ₃	CR ⁴	200
30	26	3-C ₆ H ₅ O	H	H	CR ⁴	166

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 10 -

O.Z. 0050/35319

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	Fp. (°C)
5	27 4-C(CH ₃) ₃	H	H	H	CR ⁴	210
	28 3-CF ₃	CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	CR ⁴	273
	29 3-CF ₃	CH ₃	H	CO ₂ C ₂ H ₅	CR ⁴	196
	30 4-C(CH ₃) ₃	H	H	C ₆ H ₅	CR ⁴	231
	31 4-CN	H	CH ₃	H	CR ⁴	229
	32 4-C(CH ₃) ₃	H	CH ₃	Br	CR ⁴	258
10	R ¹ 	= β-Naphthyl	H	CH ₃	H	CR ⁴
						242
15		= α-Naphthyl	H	CH ₃	H	CR ⁴
						211
						252
						222
						246
						280
20	38 3-CH ₃ O	H	H	H	-	N
	39 3-CF ₃	H	H	H	-	N
	41 4-C(CH ₃) ₃	H	H	H	-	N
	42 3-Cl	H	H	H	-	N
	43 4-Br	H	H	H	-	N
	44 3-C ₆ H ₅ O	H	H	H	-	N
25	45 4-Cl	H	H	H	-	N
	46 4-C ₂ H ₅	H	H	H	-	N
	47 4-C(CH ₃) ₃ ; 2-CH ₃	H	H	H	-	N
	48 4-C ₆ H ₅	H	H	H	-	N
	49 4-H ₁₃ C ₆ -O	H	H	H	-	N
	50 4-i-C ₃ H ₇	H	H	H	-	N
30	51 3,4-Cl ₂	H	H	H	-	N
	52 2,4-Cl ₂	H	H	H	-	N
	53 4(ClCH ₂ CH(CH ₃)CH ₂)	H	H	H	-	N
	54 4-C ₆ H ₅ CH ₂ -O	H	H	H	-	N
						268

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 11 -

O.Z. 0050/35319

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	Fp. (°C)
5	55 4-CN	H	H	-	N	345
	57 4-C(CH ₃) ₃	H	C ₆ H ₅	-	N	370
	58 4-C(CH ₃) ₃	CH ₃	CH ₃	H	CR ⁴	242
	59 4-C(CH ₃) ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CR ⁴	168
	60 4-C(CH ₃) ₃	n-C ₃ H ₇	CH ₃	H	CR ⁴	192
	61 4(4'-C(CH ₃) ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂ O)	H	CH ₃	H	CR ⁴	207
	62 4-C(CH ₃) ₃	H	CH ₃	CN	CR ⁴	300
10	R ¹ =beta-Naphthyl	H	H	-	N	201
	63 4-cycl.C ₆ H ₁₁	H	CH ₃	H	CR ⁴	200
	64 4-C(CH ₃) ₃	CH ₃	CH ₃	Br	CR ⁴	260
	65 4-C ₂ H ₅ O	CH ₃	CH ₃	H	CR ⁴	218
	66 4-C ₂ H ₅ O	H	H	-	N	258
	67 4-C ₂ H ₅ O	H	CH ₃	H	CR ⁴	185
	68 4-C ₂ H ₅ O	CH ₃	H	-	N	202
15	69 4-C ₂ H ₅ O	CH ₃	CH ₃	H	CR ⁴	168
	70 4-nH ₁₃ C ₆ O	CH ₃	CH ₃	H	CR ⁴	235
	71 4(CH ₂ =CH-CH ₂ O)	H	H	-	N	161
	72 4(CH ₂ =CH-CH ₂ O)	H	CH ₃	H	CR ⁴	102
	73 4(n-C ₄ H ₉ -CH-CH ₂ O)	H	CH ₃	H	CR ⁴	199
		C ₂ H ₅				
	74 4(n-C ₄ H ₉ -CH-CH ₂ O)	H	H	-	N	98
20		C ₂ H ₅				
	75 4(n-C ₁₂ H ₂₅ O)	H	CH ₃	H	CR ⁴	198
	76 4(n-C ₁₂ H ₂₅ O)	H	H	-	N	181
	77 4(n-C ₄ H ₉ O)	H	CH ₃	H	CR ⁴	235
	78 4(n-C ₄ H ₉ O)	H	H	-	N	211
	79 4(i-C ₄ H ₉ O)	H	CH ₃	H	CR ⁴	270
	80 4(i-C ₄ H ₉ O)	H	H	-	N	

In entsprechender Weise können die folgenden Verbindungen hergestellt werden:

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	Fp. (°C)
33	4-C(CH ₃) ₃	H	-(CH ₂) ₃ -			
40	3-CF ₃	CH ₃	H	-	N	
56	4-C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	-		

5

Die neuen Wirkstoffe zeigen eine starke fungitoxische Wirk-
 samkeit gegen phytopathogene Pilze, insbesondere aus der
 Klasse der Phycomyceten. Die neuen Verbindungen sind daher
 10 beispielsweise geeignet zur Bekämpfung von Phytophthora
 infestans an Tomaten und Kartoffeln, Phytophthora parasi-
 tica an Erdbeeren, Phytophthora cactorum an Äpfeln, Pseu-
 doperonospora cubensis an Gurken, Pseudoperonospora humuli
 an Hopfen, Peronospora destructor an Zwiebeln, Peronospora
 15 sparsa an Rosen, Peronospora tabacina an Tabak, Plasmopara
 viticola an Reben, Plasmopara halstedii an Sonnenblumen,
 Sclerospora macrospora an Mais, Bremia lactucae an Salat,
 Mucor mucedo an Früchten, Rhizopus nigricans an Rüben,
 Erysiphe graminis an Getreide, Uncinula necator an Reben,
 20 Podophyllum leucotricha an Äpfeln, Sphaerotheca fuliginea
 an Rosen, Erysiphe cichoriacearum an Gurken. Die fungiziden
 Mittel enthalten 0,1 bis 95 % (Gewichtsprozent) Wirkstoff,
 vorzugsweise 0,5 bis 90 %. Die Aufwandmengen liegen je nach
 Art des gewünschten Effektes zwischen 0,1 und 5 kg Wirk-
 25 stoff je ha.

Die neuen Wirkstoffe können auch zusammen mit anderen Wirk-
 stoffen, z.B. Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulato-
 ren und Fungiziden oder auch mit Düngemitteln vermischt und
 30 ausgebracht werden. In vielen Fällen erhält man bei der
 Mischung mit Fungiziden auch eine Vergrößerung des fungi-
 ziden Wirkungsspektrums; bei einer Anzahl dieser Fungizid-
 mischungen treten auch synergistische Effekte auf, d.h.
 die fungizide Wirksamkeit des Kombinationsproduktes ist

35

L

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 13 -

O.Z. 0050/35319

"größer als die der addierten Wirksamkeiten der Einzelkomponenten. Eine besonders günstige Vergrößerung des Wirkungsspektrums wird mit folgenden Fungiziden erzielt:

- 5 Manganethylenbisdithiocarbamat
Mangan-Zinkethylenbisdithiocarbamat
Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N-ethylen-bis-dithiocarbamat)
N-Trichlormethylthio-tetrahydropthalimid
N-Trichlormethyl-phthalimid
10 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol
2-Methoxycarbonylamino-benzimidazol
2-Rhodanmethylthiobenzthiazol
1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol
2,3-Dichlor-6-methyl-1,4-oxathiin-5-carbonsäureanilid
15 2-Methyl-5,6-dihydro-4-H-pyran-3-carbonsäure-anilid
2,4,5-Trimethyl-furan-3-carbonsäureanilid
2-Methyl-furan-3-carbonsäureanilid
2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid
N-Cyclohexyl-N-methoxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsäure-
20 -amid
5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxa-
zolidin
3-(3,5-Dichlorphenyl)-5-methyl-5-methoxymethyl-1,3-oxa-
zolidin-2,4-dion.

25
Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfundungsgemäßen Verbindungen kombiniert werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken.

30
Fungizide, die mit den erfundungsgemäßen Wirkstoffen kombiniert werden können sind beispielsweise:

35 Dithiocarbamate und deren Derivate, wie
Ferridimethyldithiocarbamat

"Zinkdimethyldithiocarbamat
 Zinkethylenbisdithiocarbamat
 Tetramethylthiuramdisulfide
 Zink-(N,N-propylen-bis-dithiocarbamat)
 5 Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat) und
 N,N'-Polypropylen-bis-(thiocarbamoyl)-disulfid

Nitroderivate, wie

10 Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat
 2-sec.-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat
 2-sec.-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat

heterocyclische Strukturen, wie

15 2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetat
 2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin
 0,0-Diethyl-phthalimidophosphonothioat
 5-Amino-1-(bis-(dimethylamino)-phosphinyl)-3-phenyl-1,2,4-triazol)
 20 2,3-Dicyano-1,4-dithiaanthrachinon
 2-Thio-1,3-dithio-(4,5-b)-chinoxalin
 1-(Butylcarbamoyl)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethylester
 4-(2-Chlorphenylhydrazone)-3-methyl-5-isoxazolon
 Pyridin-2-thio-1-oxid
 25 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz
 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid
 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin
 2-(Furyl-(2))-benzimidazol
 30 Piperazin-1,4-di-yl-bis-(1-(2,2,2-trichlor-ethyl)-formamid
 2-(Thiazolyl-(4))-benzimidazol
 5-Butyl-2-dimethylamino-4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin
 Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyridinmethanol
 35 1,2-Bis-(3-ethoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol

"1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol
sowie verschiedene Fungizide, wie
Dodecylguanidinacetat

- 5 3-(3-(3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyethyl)-glutar-imid
Hexachlorbenzol
N-Dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-phenyl-schwefelsäurediamid
- 10 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid
2-Methyl-benzoësäure-anilid
2-Jod-benzoësäure-anilid
1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan
2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholin bzw. dessen Salze
- 15 2,6-Dimethyl-N-cyclododecyl-morpholin bzw. dessen Salze
1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-
-2-butanon
1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-
-2-butanol
- 20 α -(2-Chlorphenyl)- ω -(4-chlorphenyl)-5-pyrimidin-methanol.

Die neuen Wirkstoffe werden beispielsweise in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentige wässrige, ölige oder sonstige Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten, durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen, Beizen oder Gießen angewendet. Die Aufwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der neuen Wirkstoffe gewährleisten.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten und Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin

oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle usw., sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate z.B. Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron usw., stark polare Lösungsmittel, wie z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Wasser usw. in Betracht.

10

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulvern), Öldispersionen durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen Lösungsmittel gelöst, mittels Haft-, Netz-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind. Als oberflächenaktive Stoffe kommen in Betracht:

Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäuren, Phenolsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Alkali- und Erdalkalisalze der Dibutynaphthalinsulfonsäure, Laurylethersulfat, Fettalkoholsulfate, fettsaure Alkali- und Erdalkalisalze, Salze sulfatierter Hexadecanole, Heptadecanole, Octadecanole, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfonierte Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Poloxyethylenoctylphenylether, ethoxyliertes Isooctylphenol-, Octylphenol-, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tri-

butylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole,
Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate,
ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxy-
liertes Polyoxypropylen, Laurylakoholpolyglykoletheracetal,
5 Sorbitester, Lignin, Sulfatablaugen und Methylcellulose.

Pulver, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

10

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulaten, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerde wie Silicagel, Kieselsäuren, Kreide,

15

Talkum, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehle, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehle,

20

Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Für die folgenden Versuche wurden als bekannte Vergleichswirkstoffe die folgenden Verbindungen verwendet.

25

N-Trichlormethylthio-phthalimid (Verbindung A),
7-Amino-2-methyl-5-phenyl-pyrazolo[1,5-a]-pyrimidin
(Verbindung B).

Versuch 1

30 Wirksamkeit gegen *Plasmopara viticola*

Blätter von Topfreben der Sorte "Müller-Thurgau" wurden mit wässriger Spritzbrühe, die 80 % (Gew.-%) Wirkstoff und 20 % Emulgiermittel in der Trockensubstanz enthielt, besprüht. Um die Wirkungsdauer der Wirkstoffe beurteilen zu

35

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 18 -

O.Z. 0050/35319

"können, wurden die Pflanzen nach dem Antrocknen des Spritzbelages 10 Tage im Gewächshaus aufgestellt. Erst dann wurden die Blätter mit einer Zoosporenaufschwemmung von Plasmopara viticola (Rebenperonospora) infiziert. Danach 5 wurden die Reben zunächst für 16 Stunden in einer wasser-dampfgesättigten Kammer bei 24°C und anschließend für 8 Tage in einem Gewächshaus mit Temperaturen zwischen 20 und 30°C aufgestellt. Nach dieser Zeit wurden die Pflanzen zur Beschleunigung des Sporangienträgerausbruchs aber- 10 mals für 16 Stunden in der feuchten Kammer aufgestellt. Dann erfolgte die Beurteilung des Ausmaßes des Pilzaus-bruches auf den Blattunterseiten. Beispielsweise zeigten die Wirkstoffe 1, 5, 10, 11, 12, 13, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 27, 37, 41, 42, 44 bei Anwendung einer 0,025 %igen 15 Wirkstoffbrühe eine bessere fungizide Wirkung (beispiels-weise 100 %ige Wirkung) als die bekannten Vergleichsmit-tel A und B (beispielsweise 60 %ige Wirkung).

Beispiele für Zubereitungen sind:

20

I. Man vermischt 90 Gew.-Teile der Verbindung 1 mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl-alpha-pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinstter Tropfen geeignet ist.

25

II. 20 Gew.-Teile der Verbindung 5 werden in einer Mi-schung gelöst, die aus 80 Gew.-Teilen Xylol, 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-mono-ethanol- 30 amin, 5 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzol-sulfonsäure und 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in Wasser erhält man eine wässrige Dispersion.

35

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 19 -

O.Z. 0050/35319

" III. 20 Gew.-Teile der Verbindung 10 werden in einer
Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon,
30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlage-
rungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol

5 Rizinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Ver-
teilen der Lösung in Wasser erhält man eine wässrige
Dispersion.

IV. 20 Gew.-Teile der Verbindung 11 werden in einer
10 Mischung gelöst, die aus 25 Gew.-Teilen Cyclohexanol,
65 Gew.-Teilen einer Mineralölfraktion vom Siedepunkt
210 bis 280°C und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungspro-
duktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl
besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der
15 Lösung in Wasser erhält man eine wässrige Dispersion.

V. 80 Gew.-Teile der Verbindung 37 werden mit 3 Gew.-Teilen
20 des Natriumsalzes der Diisobutynaphthalin-alpha-sulfon-
säure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Lignin-
sulfonsäure aus einer Sulfitablauge und 7 Gew.-Teilen
pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in
der Mischung in Wasser erhält man eine Spritzbrühe.

VI. 3 Gew.-Teile der Verbindung 41 werden mit 97 Gew.-Tei-
25 len feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält
auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.% des
Wirkstoffs enthält.

VII. 30 Gew.-Teile der Verbindung 42 werden mit einer
30 Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kiesel-
säuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die
Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprührt wurde,
innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine
Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit.

35

5

VIII. 40 Gew.-Teile der Verbindung 44 werden mit 10 Teilen Natriumsalz eines Phenolsulfonsäure-harnstoff-formaldehyd-Kondensates, 2 Teilen Kieselgel und 48 Teilen Wasser innig vermischt. Man erhält eine stabile wässrige Dispersion. Durch Verdünnen mit Wasser erhält man eine wässrige Dispersion.

10

IX. 20 Teile der Verbindung 1 werden mit 2 Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Teilen Fettalkohol-polyglykolether, 2 Teilen Natriumsalz eines Phenolsulfonsäure-harnstoff-formaldehyd-Kondensats und 68 Teilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölig Dispersion.

15

20

25

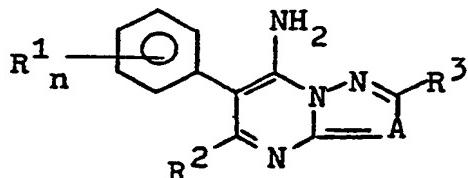
30

35

- Patentansprüche

1. 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine der Formel

5



I

10

worin

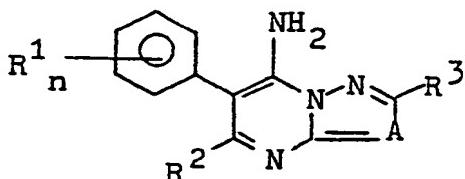
R^1 gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

n 1 oder 2

20 R^2 und R^3 Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,A ein Stickstoffatom oder eine CR^4 -Gruppe bedeutet, wobei25 R^4 die Bedeutung von R^2 hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R^3 eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

2. Fungizid enthaltend ein 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin der Formel

30



I

35

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 22 -

O.Z. 0050/35319

worin

R¹ gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

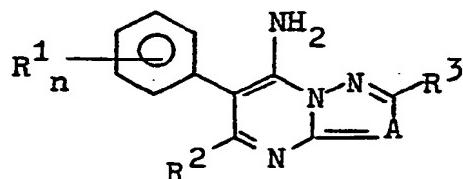
n 1 oder 2

R² und R³ Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,

A ein Stickstoffatom oder eine CR⁴-Gruppe bedeutet, wobei

R⁴ die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R³ eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

3. Fungizid, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und ein 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin der Formel



worin

R¹ gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil

35

durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

n 1 oder 2

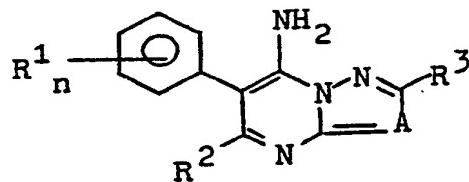
R² und R³ Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,

5 A ein Stickstoffatom oder eine CR⁴-Gruppe bedeutet,
wobei

R⁴ die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen,
Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R³
eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu

10 2 Doppelbindungen bedeutet.

4. Verfahren zur Herstellung eines Fungizids, dadurch
gekennzeichnet, daß man einen festen oder flüssigen
Trägerstoff vermischt mit einem 7-Amino-azolo[1,5-a]-
15 -pyrimidin der Formel



I

worin

R¹ gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annellierte Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

n 1 oder 2

R² und R³ Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,

A ein Stickstoffatom oder eine CR⁴-Gruppe bedeutet,
wobei

35

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 24 -

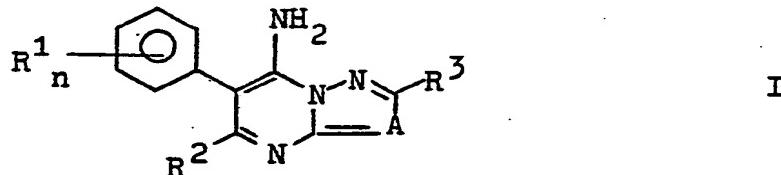
O.Z. 0050/35319

R⁴ die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R³ eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

5

5. Verfahren zur Bekämpfung von Pilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Gegenstände behandelt mit einem 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin der Formel

10



15

worin

R¹ gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

25

n 1 oder 2

R² und R³ Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,
A ein Stickstoffatom oder eine CR⁴-Gruppe bedeutet,
wobei

30

R⁴ die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R³ eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

35

0071792

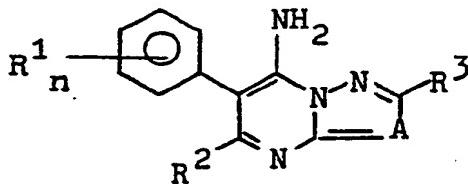
BASF Aktiengesellschaft

- 25 -

O.Z. 0050/35319

6. Verfahren zur Herstellung eines 7-Amino-azolo[1,5-a]-pyrimidins der Formel

5



worin

10 R^1 gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annellierte Benzol, Indan oder Tetrahydro-

15 naphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

n 1 oder 2

18 R^2 und R^3 Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,

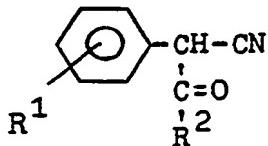
20 A ein Stickstoffatom oder eine CR^4 -Gruppe bedeutet, wobei

24 R^4 die Bedeutung von R^2 hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R^3 eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu

25 2 Doppelbindungen bedeutet,

dadurch gekennzeichnet, daß man ein substituiertes Benzylcyanid der Formel

30



II,

in der R^1 und R^2 die im Anspruch 1 genannte Bedeutung haben, mit einem 5(3)-Aminopyrazol der Formel

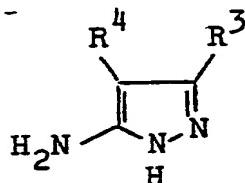
35

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 26 -

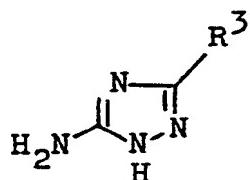
O.Z. 0050/35319



III.

5

oder mit einem 5(3)-Amino-1,2,4-triazol der Formel



IV.

10

in welcher R^3 und R^4 die im Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben, umgesetzt.

15

7. 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß R^2 Wasserstoff oder Methyl, R^3 Wasserstoff oder Methyl und R^4 Wasserstoff bedeutet.
 8. Fungizid, enthaltend ein 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin, definiert wie in Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß R^2 Wasserstoff oder Methyl, R^3 Wasserstoff oder Methyl und R^4 Wasserstoff bedeutet.

25

30

35

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 27 -

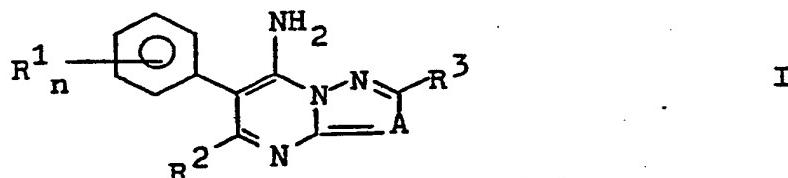
O.Z. 0050/35319

Patentansprüche (für Österreich)

1. Fungizid enthaltend ein 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin der Formel

5

10



worin

R¹ gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

n 1 oder 2

R² und R³ Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,
A ein Stickstoffatom oder eine CR⁴-Gruppe bedeutet,

25 wobei

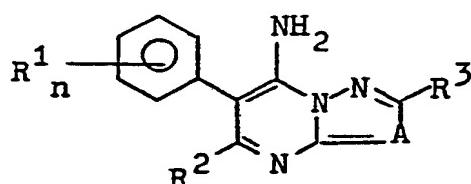
R⁴ die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R³ eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

30

2. Fungizid, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und ein 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin der Formel

35

5



worin

R¹ gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

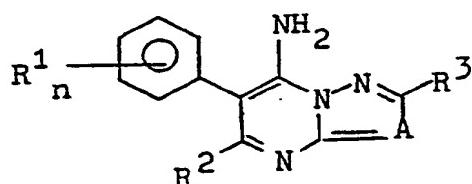
n 1 oder 2

R² und R³ Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,
A ein Stickstoffatom oder eine CR⁴-Gruppe bedeutet,
wobei

R⁴ die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R³ eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

25 3. Verfahren zur Herstellung eines Fungizids, dadurch gekennzeichnet, daß man einen festen oder flüssigen Trägerstoff vermischt mit einem 7-Amino-azolo[1,5-a]-pyrimidin der Formel

30



35

worin

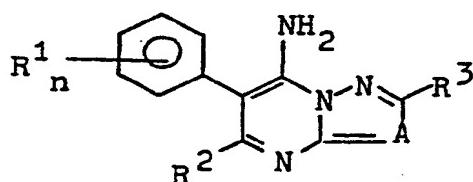
5 R¹ gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

10 n 1 oder 2

R² und R³ Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,
A ein Stickstoffatom oder eine CR⁴-Gruppe bedeutet,
wobei

15 R⁴ die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R³ eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

20 4. Verfahren zur Bekämpfung von Pilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Gegenstände behandelt mit einem 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin der Formel



worin

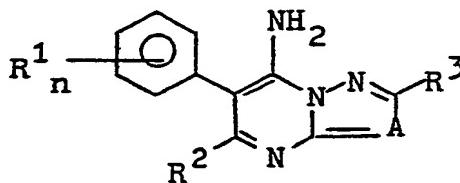
30 R¹ gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin,

35

lin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

- 5 n 1 oder 2
 R^2 und R^3 Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,
 A ein Stickstoffatom oder eine CR^4 -Gruppe bedeutet,
 wobei
 R^4 die Bedeutung von R^2 hat und zusätzlich Halogen,
 Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R^3
 10 eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu
 2 Doppelbindungen bedeutet.

5. Verfahren zur Herstellung eines 7-Amino-azolo[1,5-a]-
 15 pyrimidins der Formel



worin

- 20 R^1 gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annellierte Benzol, Indan oder Tetrahydro-naphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,
 n 1 oder 2
 R^2 und R^3 Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,
 A ein Stickstoffatom oder eine CR^4 -Gruppe bedeutet,
 wobei
 35 R^4 die Bedeutung von R^2 hat und zusätzlich Halogen,

0071792

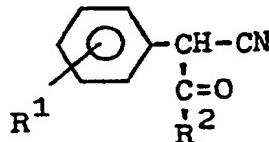
BASF Aktiengesellschaft

- 31 -

O.Z. 0050/35139

5

Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R³
 eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu
 2 Doppelbindungen bedeutet,
dadurch gekennzeichnet, daß man ein substituiertes
 Benzylcyanid der Formel

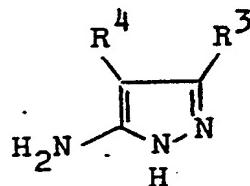


II,

10

in der R¹ und R² die im Anspruch 1 genannte Bedeutung
 haben, mit einem 5(3)-Aminopyrazol der Formel

15

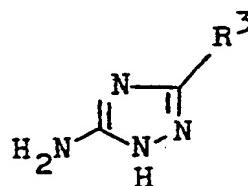


III,

20

oder mit einem 5(3)-Amino-1,2,4-triazol der Formel

25



IV,

in welcher R³ und R⁴ die im Anspruch 1 angegebenen
 Bedeutungen haben, umsetzt.

30 6.

Fungizid, enthaltend ein 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin, definiert wie in Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß R² Wasserstoff oder Methyl, R³ Wasserstoff oder Methyl und R⁴ Wasserstoff bedeutet.

35



Europäisches Patentamt
European Patent Office
Office européen des brevets

(11) Veröffentlichungsnummer:

O 071 792
A3

(12)

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 82106335.1

(51) Int. Cl.³: **C 07 D 487/04**

A 01 N 43/90

//(C07D487/04, 239/00, 231/00),
(C07D487/04, 249/00, 239/00)

(22) Anmeldetag: 15.07.82

(30) Priorität: 01.08.81 DE 3130633

(71) Anmelder: BASF Aktiengesellschaft

Carl-Bosch-Straße 38
D-6700 Ludwigshafen(DE)

(43) Veröffentlichungstag der Anmeldung:
16.02.83 Patentblatt 83/7

(72) Erfinder: Eicken, Karl, Dr.
Waldstrasse 63
D-6706 Wachenheim(DE)

(88) Veröffentlichungstag des später
veröffentlichten Recherchenberichts: 06.04.83

(72) Erfinder: Scheib, Klaus, Dr.
Duerkheimer Strasse 7
D-6701 Schauernheim(DE)

(84) Benannte Vertragsstaaten:
AT BE CH DE FR GB IT LI LU NL SE

(72) Erfinder: Theobald, Hans, Dr.
Parkstrasse 2
D-6703 Limburgerhof(DE)

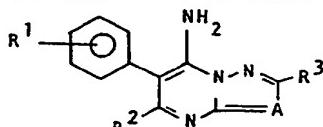
(72) Erfinder: Pommer, Ernst-Heinrich, Dr.
Berliner Platz 7
D-6703 Limburgerhof(DE)

(72) Erfinder: Ammermann, Eberhard, Dr.
Sachsenstrasse 3
D-6700 Ludwigshafen(DE)

(54) 7-Amino-azolo(1,5-a)pyrimidine und diese enthaltende Fungizide.

Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbin-
dungen bedeutet und diese enthaltende Fungizide.

(57) 7-Amino-azolo[1,5-a] pyrimidine der Formel



worin

R¹ gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxy, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annellierte Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls substituiert sind,

R² und R³ Wasserstoff, Alkyl oder Aryl,

n 1 oder 2,

A ein Stickstoffatom oder eine CR⁴-Gruppe bedeutet,
wobei

R⁴ die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxycarbonyl und zusammen mit R³ eine

EP 0 071 792 A3



Europäisches
Patentamt

EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

0071792
Nummer der Anmeldung

EP 82 10 6335

EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE

Kategorie	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich, der maßgeblichen Teile	Betrifft Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int. Cl. 3)
A	<p>---</p> <p>CHEMICAL ABSTRACTS, Band 63, Nr. 2, 19. Juli 1965, Spalte 1804f, Columbus, Ohio, USA & JP - A - 65 2679 (SHIONOGI & CO., LTD.) * Zusammenfassung *</p> <p>-----</p>	1	C 07 D 487/04 A 01 N 43/90 (C 07 D 487/04 C 07 D 239/00 C 07 D 231/00) (C 07 D 487/04 C 07 D 249/00 C 07 D 239/00) //)
RECHERCHIERTE SACHGEBiete (Int. Cl. 3)			
C 07 D 487/00 A 01 N 43/00			
Der vorliegende Recherchenbericht wurde für alle Patentansprüche erstellt.			
Recherchenort DEN HAAG	Abschlußdatum der Recherche 13-01-1983	Prüfer ALFARO I.	
KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTEN X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie A : technologischer Hintergrund O : nichtschriftliche Offenbarung P : Zwischenliteratur T : Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze			
E : älteres Patentdokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmeldedatum veröffentlicht worden ist D : in der Anmeldung angeführtes Dokument L : aus andern Gründen angeführtes Dokument & : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument			